

⑬日本国特許庁(JP)

①特許出願公開

⑫公開特許公報(A)

昭54—125632

⑤Int. Cl.²
C 07 C 103/84 //
A 61 K 31/60

識別記号 ⑥日本分類
A A G 16 C 624
A A H 16 C 64
A B E 30 G 143
A B F 30 H 111.4
30 H 111.5
30 H 22
30 H 23

⑦公開 昭和54年(1979)9月29日
⑧特許出願番号 7330—4H
⑨発明の数 1
⑩審査請求 未請求
6617—4C
6617—4C
6617—4C
6617—4C

(全 2 頁)

⑭新規なサリチル酸誘導体

⑮特 願 昭53—31883
⑯出 願 昭53(1978)3月20日
⑰発 明 者 野田寛治
筑紫野市大字常松320番地の93
同 中川晃
鳥栖市藤木町970番地の11
同 本村敏治

鳥栖市桜町1175の3番地
⑱発 明 者 辻正義
鳥栖市蔵上町26—1
同 天野英敏
鳥栖市田代外町636
同 井出博之
福岡市中央区平尾4丁目10の11
⑲出 願 人 久光製薬株式会社
鳥栖市田代大官町408番地

明 細 書

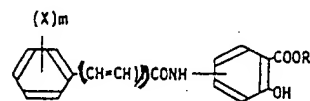
明 細 書

1. 発明の名称

新規なサリチル酸誘導体

2. 特許請求の範囲

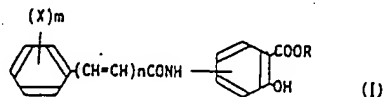
1. 一般式



(式中、Rは水素原子又は低級アルキル基を、Xは低級アルコキシ基を、mは1～3の整数を、nは0又は1の整数を意味する)で表わされる新規なサリチル酸誘導体。

3. 発明の詳細な説明

本発明は一般式(I)



(式中、Rは水素原子又は低級アルキル基を、X

は低級アルコキシ基を、mは1～3の整数を、nは0又は1の整数を意味する)で表わされる新規なサリチル酸誘導体に関するものである。

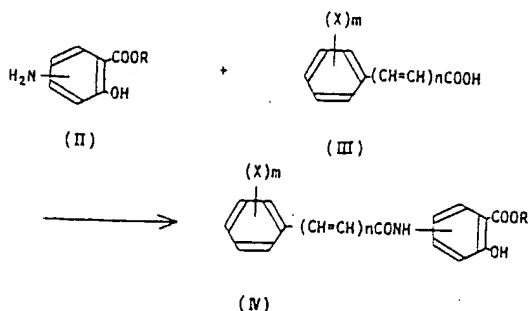
前記一般式(I)におけるR及びXに就いて更に具体的に説明するとRの低級アルキル基としては、例えばメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル及びイソブチル基等があげられる。又、Xの低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ及びイソブトキシ基等があげられる。

本発明の前記一般式(I)のサリチル酸誘導体は文献記載の新規化合物であり、顕著な抗アレルギー作用及び解熱、鎮痛、抗炎症作用等を有し、医薬品として産業上有用な化合物である。

本発明の化合物は下記の反応式で示す方法によって収率よく得ることが出来るが、これらの製法は一例にすぎず勿論他の化学的類似方法によっても製造することが出来るものである。

製造法

一般式(II)で表わされる化合物に一般式(III)で表わされるカルボン酸の反応性誘導体を反応させる方法。



(式中、m, n, X及びRは前記と同じ意味を有する)

前記製造法を更に具体的に説明すると、当該方法は一般式(II)で表わされるサリチル酸誘導体に、一般式(III)で表わされるカルボン酸の反応性誘導体(例えば、酸ハライド、酸無水物)をテトラヒドロフラン、アセトン、クロロホルム、ピリジン、ベンゼン、トルエン等の有機溶媒中反応させれば

よい。又、酸ハライドを使用する場合は脱炭酸剤(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、ピリジン、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等)を使用すれば反応は速やかに進行しサリチル酸誘導体(IV)を得ることが出来る。

以下に実施例を示し、本発明を更に具体的に説明する。

実施例1

5-アミノサリチル酸3.1gをテトラヒドロフラン30mlとトリエチルアミン3mlとの混液に溶解した。これに3,4,5-トリメトキシ安息香酸クロリド4.6gのテトラヒドロフラン溶液を冷却下に滴下した。その後、室温で5時間攪拌した。反応終了後、減圧下に溶媒を留去し残渣に水及び希塩酸を加えて弱酸性とし、析出する結晶を回収してジメチルホルムアミドより再結晶すると無色プリズム晶のN-(3,4,5-トリメトキシベンゾイル)-5-アミノサリチル酸4.7gを得た。

この物質の融点及び元素分析値は次の通りであった。

| | |
|-------|---|
| 融点 | 250~253℃ |
| 元素分析値 | C ₁₇ H ₁₇ NO ₇ |
| 理論値 | C:58.79 H:4.93 N:4.03 |
| 実測値 | C:58.83 H:4.87 N:4.08 |

実施例2

4-アミノサリチル酸3.1gをクロロホルム3.0mlとトリエチルアミン3mlとの混液に溶解した。これに3,4-ジメトキシベンズ酸クロリド4.5gのクロロホルム溶液を冷却下に滴下した。その後、室温で2時間攪拌し、さらに還流下に1時間反応させた。反応終了後、減圧下に溶媒を留去し残渣に水及び希塩酸を加えて弱酸性とし、析出する結晶を回収してジメチルホルムアミドより再結晶すると無色プリズム晶のN-(3,4-ジメトキシベンゾイル)-4-アミノサリチル酸2.4gを得た。

この物質の融点及び元素分析値は次の通りであった。

| | |
|-------|---|
| 融点 | 250~251℃ |
| 元素分析値 | C ₁₈ H ₁₇ NO ₆ |

| | |
|-----|-----------------------|
| 理論値 | C:62.97 H:4.99 N:4.08 |
| 実測値 | C:62.89 H:5.03 N:4.06 |

以下、実施例2の方法に準じて下記の化合物を合成した。

N-(3,4-ジメトキシシンナモイル)-5-アミノサリチル酸

融点 260~261℃

N-(3,4,5-ジメトキシシンナモイル)-5-アミノサリチル酸

融点 258~259℃

N-(3,4,5-トリメトキシベンゾイル)-5-アミノサリチル酸メチルエステル

融点 195~197℃

N-(3,4,5-トリメトキシシンナモイル)-5-アミノサリチル酸イソプロピルエステル

融点 154~156℃

特許出願人

久光製薬株式会社

代表者 中 葛 正 義

